

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2002-003330  
(43)Date of publication of application : 09.01.2002

(51)Int.Cl.

A61K 7/00  
A61K 31/047  
A61K 31/341  
A61P 31/04  
// C07D307/62

(21)Application number : 2000-186187  
(22)Date of filing : 21.06.2000

(71)Applicant : TOYO BEAUTY KK  
(72)Inventor : YAMAGUCHI TAKASHI  
TANIGUCHI MASAYUKI  
SHIBAYAMA YUJI

## (54) COSMETIC

### (57)Abstract:

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To prepare a cosmetic prepared by compounding a water-soluble ascorbic acid derivative, capable of exhibiting antibacterial and antiseptic properties, resistant to coagulation and precipitation, and having stable quality with passage of time.

**SOLUTION:** This cosmetic contains 0.1-5 wt.% of a water-soluble ascorbic acid derivative such as an ascorbic phosphoric ester magnesium salt, 0.5-10 wt.% of a 1,2-alkanediol and water as essential components. Compounding the 1,2-alkanediol together with the water-soluble ascorbic acid derivative as essential components imparts antibacterial and antiseptic properties to the cosmetic, and stabilizes it in terms of passage of time so that coagulation and precipitation do not occur.

## LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号  
特開2002-3330

(P 2 0 0 2 - 3 3 3 0 A)

(43) 公開日 平成14年1月9日 (2002.1.9)

(51) Int. Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テマコード (参考)
A61K 7/00		A61K 7/00	C 4C037
			H 4C083
			M 4C086
			N 4C206
31/047		31/047	

審査請求 未請求 請求項の数 3 O L (全 5 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2000-186187 (P 2000-186187)	(71) 出願人	592215011 東洋ビューティ株式会社 大阪府大阪市東成区東中本3丁目13番8号
(22) 出願日	平成12年6月21日 (2000.6.21)	(72) 発明者	山口 剛史 大阪市東成区東中本3丁目13番8号 東洋 ビューティ株式会社内
		(72) 発明者	谷口 雅幸 大阪市東成区東中本3丁目13番8号 東洋 ビューティ株式会社内
		(74) 代理人	100074206 弁理士 鎌田 文二 (外2名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 化粧料

(57) 【要約】

【課題】 水溶性アスコルビン酸誘導体を配合した化粧料において、化粧料に抗菌性や防腐性を発揮させ、しかも凝集や沈殿の起こり難いものとして経日的に品質の安定した化粧料とすることである。

【解決手段】 アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩などの水溶性アスコルビン酸誘導体を0.1～5重量%と、1,2-アルカンジオールを0.5～10重量%と、水を必須成分として含有する化粧料とする。必須成分として水溶性アスコルビン酸誘導体と共に1,2-アルカンジオールを配合することによって、抗菌性および防腐性を有し、凝集や沈殿が生じないで経日的に安定した化粧料になる。

## 【特許請求の範囲】

【請求項 1】 水溶性アスコルビン酸誘導体および 1, 2-アルカンジオールを抗菌性成分として含有する化粧料。

【請求項 2】 水溶性アスコルビン酸誘導体が、アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩またはアスコルビン酸リン酸エステルナトリウム塩である請求項 1 記載の化粧料。

【請求項 3】 水溶性アスコルビン酸誘導体 0. 1 ~ 5 重量%、1, 2-アルカンジオール 0. 5 ~ 1 0 重量% および水を必須成分として含有する化粧料。

## 【発明の詳細な説明】

【0 0 0 1】

【発明の属する技術分野】 この発明は、水溶性アスコルビン酸誘導体を含有する化粧料に関するものである。

【0 0 0 2】

【従来の技術】 一般に、アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩などの水溶性アスコルビン酸誘導体を含有する化粧料が知られている。水溶性アスコルビン酸誘導体は、皮膚への吸収性もよく、皮膚内の酸性フォスファターゼと反応してアスコルビン酸に変換し、美白などの効果を発揮する。

【0 0 0 3】 また、アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウムは、他の配合成分との組み合わせによって経日安定性が低下しやすいので、その安定剤として炭素数 2 ~ 6 の有機酸でカルボキシル基及び水酸基を各 1 個以上有するもの、またはカルボキシル基を有する水溶性高分子化合物として、例えばリンゴ酸、リンゴ酸ナトリウム、グルコン酸、グルコン酸ナトリウム、オキサロ酢酸、グリセリン酸または乳酸を添加して経日安定性を高めた化粧料も知られている（特開平 5 - 3 3 9 1 2 3 号公報）。

【0 0 0 4】 ところで、化粧料の成分として、防腐性成分を配合することなく水と共に水溶性アスコルビン酸誘導体を配合すると、このような化粧料には防腐性がなくなり、腐敗しやすくなる。

【0 0 0 5】

【発明が解決しようとする課題】 しかし、水溶性アスコルビン酸誘導体を配合した化粧料の防腐性を高めるために、1, 3-ブチレングリコールやエタノールなどを配合すると、アスコルビン酸誘導体の水溶性が低下して化粧料は凝集や沈殿を起こしやすくなるという問題が起こる。

【0 0 0 6】 化粧品において上述のような凝集や沈殿が起こると、製品の外観を害するだけでなく、ビタミン C の美白などの作用効果を損なうことになり、また生じた析出物によって皮膚を刺激することにもなる。

【0 0 0 7】 そこで、この発明の課題は、水溶性アスコルビン酸誘導体を配合した化粧料における上記した問題を解決して抗菌性や防腐性を発揮させ、しかも凝集や

沈殿の起こり難いものとして経日的に品質の安定した化粧料とすることである。

【0 0 0 8】

【課題を解決するための手段】 上記の課題を解決するために、本願の化粧料に係る発明では、水溶性アスコルビン酸誘導体および 1, 2-アルカンジオールを抗菌性成分として含有する化粧料としたのである。水溶性アスコルビン酸誘導体は、アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩またはアスコルビン酸リン酸エステルナトリウム塩を採用することができる。

【0 0 0 9】 この発明の化粧料は、必須成分として水溶性アスコルビン酸誘導体と共に 1, 2-アルカンジオールを配合することによって、アルコール類を添加しなくても抗菌性および防腐性を有する化粧料になり、しかも水溶性アスコルビン酸誘導体の凝集や沈殿が生じないので、製品の外観や肌触りに経日変化のない安定した品質の化粧料になる。

【0 0 1 0】 また、水溶性アスコルビン酸誘導体を 0. 1 ~ 5 重量%と、1, 2-アルカンジオールを 0. 5 ~ 1 0 重量%と、水を必須成分として含有する化粧料は、上記したような経日安定性および抗菌作用が、より確実に奏される化粧料になる。

【0 0 1 1】

【発明の実施の形態】 本願の化粧料に係る発明に用いる水溶性アスコルビン酸誘導体は、親水性のアスコルビン酸誘導体をいい、その一種もしくは二種以上の組み合わせで用いられる。水溶性アスコルビン酸誘導体としては、例えば、L-アスコルビン酸リン酸エステル、L-アスコルビン酸リン酸エステルナトリウム塩、L-アスコルビン酸リン酸エステルカリウム塩、L-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩、L-アスコルビン酸リン酸エステルトリエタノールアミン塩等の L-アスコルビン酸リン酸エステル塩、L-アスコルビン酸硫酸エステル、L-アスコルビン酸硫酸エステル塩等を挙げることができる。この発明では、特に L-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩または L-アスコルビン酸リン酸エステルナトリウム塩を用いて好ましい結果を得ている。

【0 0 1 2】 水溶性アスコルビン酸誘導体の配合割合は、0. 1 重量% ~ 5. 0 重量%が適当である。なぜなら、0. 1 重量%未満の配合割合では、化粧料に所期した美白作用や抗菌・防腐作用を確実に発揮させることが困難になり、5. 0 重量%を超える配合割合では、保存安定性に問題が生じて好ましくないからである。

【0 0 1 3】 この発明に用いる 1, 2-アルカンジオールは、水に可溶もしくは混合可能な物性であり、アルカンとしては炭素数 3 ~ 6 のアルカンであり、また光学異性体として 1, 3-アルカンジオールなどを採用すると、抗菌・防腐作用を確実に発揮させることが困難になるので好ましくない。

【0014】この発明に用いる1, 2-アルカンジオールの具体例としては、1, 2-プロパンジオール、1, 2-ブタンジオール、1, 2-ペンタンジオール、1, 2-ヘキサンジオール等が挙げられる。

【0015】このような1, 2-アルカンジオールの少なくとも一種もしくは二種以上の配合量は、0.5~10重量%が適当である。なぜなら、0.5重量%未満の少量では、水溶性アスコルビン酸誘導体を配合した化粧料に所期した抗菌性を安定して発揮させることが困難になり、10重量%を越えて配合すると、水溶性アスコルビン酸誘導体を配合した化粧料の保存安定性に問題があり、好ましくないからである。

【0016】この発明は、特に水を多く含有する系や外相が水相である系に有用であり、特に水-油のエマルジョンや水溶液状の化粧料に適用できるものである。すなわち、この発明は、例えば、化粧水、乳液、クリーム等の皮膚化粧料として提供できるものである。

【0017】化粧料に油相成分を含有させる場合には、牛脂、スクワラン、オリーブ油などの動植物性油脂、炭化水素、脂肪酸、シリコーン油、フッ素オイル及びイソプロピル糖脂肪酸、マルチトール脂肪酸エステルなどの糖あるいは糖アルコール脂肪酸エステル、グリセリン脂

肪酸エステル、ポリグリセリン脂肪酸エステルなどの多価アルコール脂肪酸エステル、酸化エチレン付加型界面活性剤などの非イオン界面活性剤などがある。

【0018】使用目的にあわせて、アニオン界面活性剤、カチオン界面活性剤、両性界面活性剤を添加してもよい。また均一安定化、粘度調整などの目的で蛋白質、ペプチド、デンプンなどの水溶性高分子を添加してもよい。

【0019】

【実施例および比較例】実施例の化粧料に使用した材料のうち、必須成分を以下に列挙する。

<水溶性アスコルビン酸誘導体>

① L-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム

② L-アスコルビン酸リン酸エステルナトリウム

<1, 2-アルカンジオール>

③ 1, 2-ペンタンジオール

④ 1, 2-ヘキサンジオール

【実施例1~3、比較例1~3】表1に示す配合割合

(重量%)で実施例と比較例中の各成分を順に精製水に添加し、均一に溶解させて化粧料を調製した。

【0020】

【表1】

番 号 配合割合 (重量%)	実施例			比較例		
	1	2	3	1	2	3
精製水	97.9	94.0	94.0	98.9	95.9	94.0
クエン酸ナトリウム	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
①L-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム	0.1	3.0	3.0	0.1	3.0	3.0
③1,2-ペンタンジオール	1.0	2.0	1.0	—	0.1	—
④1,2-ヘキサンジオール	—	—	1.0	—	—	—
1,3-ブタンジオール	—	—	—	—	—	8.0

【0021】実施例及び比較例に対し、これらの抗菌活性と状態変化を以下の試験方法で評価し、これらの結果は表2中にまとめて示した。

「抗菌活性の評価試験」細菌として大腸菌：エチエリヒア コリ (Escherichia coli)、黄色ブドウ球菌：スタフィロコッカス オーレウス (Staphylococcus aureus)、および緑膿菌：シウドモナス アルギノーサ (Pseudomonas aeruginosa) を用い、真菌としてカンジダ：カンジダ アルビカンス (Candida albicans)、黒カビ：アスペルギルス ニガー (Aspergillus niger) を用い、細菌は10<sup>6</sup>個、真菌は10g当たり10<sup>5</sup>個を植菌し、37℃及び25℃でそれぞれ培養して、2週間後の生菌数を測定した。細菌については死滅した場

合、真菌については生菌数が1/1000以下となった場合に抗菌活性が良好である(○印)、1種または2種の菌にのみ抗菌活性が認めらる(△印)、全く認められなかった(×印)という3段階に評価し、表2中に括弧内の記号で示した。

「経日安定性の評価試験」40℃で3ヶ月間、所定容器に充填し沈殿や析出の有無を目視にて観察し、調製直後に比較して均質で変化がなければ経日安定性が良好である(○印)、沈殿や析出を生じてしまい経日安定性が充分でない(×印)という2段階に評価し、表2中に括弧内の記号で記した。

【0022】

【表2】

評価試験の対象	抗菌活性の評価	経日安定性の評価
実施例 1	○	○
実施例 2	○	○
実施例 3	○	○
比較例 1	×	○
比較例 2	×	○
比較例 3	△	×

【0023】表2の結果からも明らかなように、実施例1～3においては十分な抗菌活性及び経日安定性が認められたのに対し、比較例3においては、沈殿物が生じ、一部の菌に対しては抗菌活性の認められたものもあったが、比較例1、2では全く抗菌活性が認められなかった。

【実施例4、比較例4】（化粧用乳液の調製）

配合割合（重量％）		実施例 4	比較例 4
水相成分	精製水	65.35	67.35
	クインスードエキス	1.00	1.00
	ヒアルロン酸ナトリウム	0.10	0.10
	③ 1,2-ペンタンジオール	2.00	—
油相成分	セタノール	1.00	1.00
	モノステアリン酸グリセリル	0.50	0.50
	スクワラン	5.00	5.00
	モノステアリン酸ポリエチレングリコール(40EO)	1.00	1.00
① L-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム		3.00	3.00
精製水		20.00	20.00
クエン酸ナトリウム		1.0	1.0
香料		0.05	0.05

【0025】実施例4についても、実施例1と全く同様にして評価試験を行なったが、十分な抗菌活性及び経日安定性が認められたのに対して、比較例4では経日安定性については問題なかったが、全く抗菌活性が認められなかった。

【実施例5、比較例5】（化粧用クリーム）

表4に示す配合割合（重量％）で実施例5または比較例5の油相成分を混合し加熱溶解して75℃に保った。一方、表4の材料の水相成分を混合し、加熱溶解後、これに前記の油相を攪拌しながら添加して乳化した。これを冷却後、40℃にてその他の材料を添加し混合してクリームを得た。

【0026】

【表4】

配合割合（重量％）		実施例 5	比較例 5
水相成分	精製水	59.35	61.35
	クインスードエキス	1.00	1.00
	ヒアルロン酸ナトリウム	0.10	0.10
	④ 1,2-ヘキサジオール	2.00	—
油相成分	セタノール	2.00	2.00
	モノステアリン酸グリセリル	0.50	0.50
	スクワラン	10.00	10.00
	モノステアリン酸ポリエチレングリコール(40EO)	1.00	1.00
① L-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム		2.00	2.00
② L-アスコルビン酸リン酸エステルナトリウム		1.00	1.00
精製水		20.00	20.0
クエン酸ナトリウム		1.0	1.0
香料		0.05	0.05

表3に示す配合割合（重量％）で実施例4、比較例4の油相成分を混合し加熱溶解して75℃に保った。一方、表3の水相成分を混合し、加熱溶解後、これに前記の油相を攪拌しながら添加して乳化した。これを冷却後、40℃にてその他の材料を添加し混合して乳液を得た。

【0024】

【表3】

【0027】実施例5についても、実施例1と全く同様にして評価試験を行なったが、十分な抗菌活性及び経日安定性が認められたのに対して、比較例5では経日安定性については問題なかったが、全く抗菌活性が認められなかった。

【実施例6、比較例6】（化粧水）

表5に示す配合割合（重量％）で実施例6、比較例6の材料を混合、溶解して化粧水を得た。

【0028】

【表5】

配合割合 (重量%)	実施例 6	比較例 6
精製水	85.5	85.5
クインスシードエキス	0.5	0.5
グリセリン	1.0	1.0
α-ブタン-水	1.0	1.0
クエン酸ナトリウム	1.0	1.0
①L-アスコルビン酸リン酸 エステルマグネシウム	3.0	3.0
②1,2-ペンタンジオール	8.0	—
1,3-ブタンジオール	—	8.0

【0029】実施例6についても、実施例1と全く同様にして評価試験を行なったが、十分な結果が認められたのに対して、比較例6では沈殿物が生じるといった経日安定性についての問題を生じ、また十分な抗菌活性を認めることができなかった。

【0030】

【発明の効果】この発明は、以上説明したように、アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩などの水溶性アスコルビン酸誘導体および1, 2-アルカンジオール

を抗菌性成分として含有する化粧料としたので、化粧料に抗菌性や防腐性をもたせることができるようになり、しかも凝集や沈殿の起こり難く、換言すれば経日的に品質の安定した化粧料になるという利点がある。

【0031】また、水溶性アスコルビン酸誘導体と、1, 2-アルカンジオールとをそれぞれ所定量配合し、かつ水を必須成分として含有する化粧料とした発明は、上記したような利点がより確実に奏される化粧料になる。

フロントページの続き

(51) Int. Cl.<sup>7</sup>

識別記号

F I

ターコード (参考)

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/341

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/04

// C 0 7 D 307/62

C 0 7 D 307/62

(72) 発明者 柴山 裕治

大阪市東成区東中本3丁目13番8号 東洋  
ビューティ株式会社内

F ターム (参考) 4C037 LA03

4C083 AA112 AC022 AC072 AC111

AC112 AC122 AC302 AC402

AC422 AD332 AD352 BB48

CC04 CC05 DD23 DD27 DD31

EE13

4C086 AA01 AA02 BA18 MA02 MA04

NA14 ZA90 ZB35

4C206 AA01 AA02 CA05 MA02 MA04

NA14 ZA90 ZB35